

【公報種別】特許法第 17 条の 2 の規定による補正の掲載

【部門区分】第 3 部門第 2 区分

【発行日】令和 1 年 5 月 16 日 (2019.5.16)

【公表番号】特表 2018-513863 (P2018-513863A)

【公表日】平成 30 年 5 月 31 日 (2018.5.31)

【年通号数】公開・登録公報 2018-020

【出願番号】特願 2017-554566 (P2017-554566)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/472 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 K 9/20 (2006.01)

A 6 1 K 47/32 (2006.01)

A 6 1 K 47/38 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 K 9/14 (2006.01)

【 F I 】

A 6 1 K 31/472

A 6 1 P 35/00

A 6 1 K 9/20

A 6 1 K 47/32

A 6 1 K 47/38

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 K 9/14

【手続補正書】

【提出日】平成 31 年 4 月 3 日 (2019.4.3)

【手続補正 1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

4 - [ 2 - (シクロプロピルメトキシ) - 5 - メチルスルホニルフェニル ] - 2 - メチルイソキノリン - 1 - オンの結晶形態 A を含む医薬組成物。

【請求項 2】

7 . 8、9 . 0、15 . 7、18 . 0、21 . 1、22 . 0、23 . 6、および 24 . 5 の 2 シータ ( ) で X 線粉末回折 ( X R P D ) 反射ピークを示すことを特徴とする、4 - [ 2 - (シクロプロピル - メトキシ) - 5 - メチルスルホニルフェニル ] - 2 - メチルイソキノリン - 1 - オンの結晶形態 A を含む医薬組成物。

【請求項 3】

非晶質の 4 - [ 2 - (シクロプロピルメトキシ) - 5 - メチルスルホニルフェニル ] - 2 - メチルイソキノリン - 1 - オンの固体形態を含む医薬組成物。

【請求項 4】

4 - [ 2 - (シクロプロピルメトキシ) - 5 - メチルスルホニルフェニル ] - 2 - メチルイソキノリン - 1 - オンを含む医薬組成物であって、4 - [ 2 - (シクロプロピルメトキシ) - 5 - メチルスルホニルフェニル ] - 2 - メチルイソキノリン - 1 -オンは噴霧乾燥により処理される、医薬組成物。

【請求項 5】

4 - [ 2 - (シクロプロピルメトキシ) - 5 - メチルスルホニルフェニル ] - 2 - メチルイソキノリン - 1 - オンを含む医薬組成物であって、4 - [ 2 - (シクロプロピルメトキシ) - 5 - メチルスルホニルフェニル ] - 2 - メチルイソキノリン - 1 -オンは、超臨界CO<sub>2</sub>溶液 (RESS) プロセスの急速な拡大により微粒子化される、医薬組成物。

【請求項 6】

4 - [ 2 - (シクロプロピルメトキシ) - 5 - メチルスルホニルフェニル ] - 2 - メチルイソキノリン - 1 - オンと少なくとも 1 つの固体のマトリックスポリマーを含む、医薬組成物。

【請求項 7】

固体のマトリックスポリマーはポリビニルピロリドンまたはポリビニルピロリドン誘導体である、請求項 6 に記載の医薬組成物。

【請求項 8】

固体のマトリックスポリマーはセルロース誘導体である、請求項 6 に記載の医薬組成物。

【請求項 9】

セルロース誘導体は、ヒドロキシプロピルメチルセルロースである、請求項 8 に記載の医薬組成物。

【請求項 10】

セルロース誘導体は、ヒドロキシプロピルメチルセルロースフタレートである、請求項 8 に記載の医薬組成物。

【請求項 11】

セルロース誘導体は、ヒドロキシプロピルメチルセルロースアセテートステアレートである、請求項 8 に記載の医薬組成物。

【請求項 12】

セルロース誘導体は、ヒドロキシプロピルメチルセルロースアセテートスクシナートである、請求項 8 に記載の医薬組成物。

【請求項 13】

医薬組成物は噴霧乾燥によって処理される、請求項 1 - 12 のいずれか 1 つに記載の医薬組成物。

【請求項 14】

4 - [ 2 - (シクロプロピルメトキシ) - 5 - メチルスルホニルフェニル ] - 2 - メチルイソキノリン - 1 - オン対固体のマトリックスポリマーの比率が約 1 : 1 ~ 約 1 : 9 である、請求項 1 - 13 のいずれか 1 つに記載の医薬組成物。

【請求項 15】

4 - [ 2 - (シクロプロピルメトキシ) - 5 - メチルスルホニルフェニル ] - 2 - メチルイソキノリン - 1 - オン対固体のマトリックスポリマーの比率が 1 : 1、1 : 2、1 : 3、1 : 4、1 : 5、1 : 6、1 : 7、1 : 8、または 1 : 9 から選択される、請求項 10 に記載の医薬組成物。

【請求項 16】

( a ) 4 - [ 2 - (シクロプロピルメトキシ) - 5 - メチルスルホニルフェニル ] - 2 - メチルイソキノリン - 1 - オンの非晶質形態と、( b ) ポリビニルピロリドンまたはヒドロキシプロピルメチルセルロースから選択されたポリマーとを含む、固体のポリマーマトリックスを含んでいる医薬組成物であって、固体のポリマーマトリックスは噴霧乾燥分散剤である、医薬組成物。

【請求項 17】

ポリマーは、約 1 : 3 の 4 - [ 2 - (シクロプロピルメトキシ) - 5 - メチルスルホニルフェニル ] - 2 - メチルイソキノリン - 1 - オン；ポリマーの比率で存在するヒドロキシプロピルメチルセルロースである、請求項 16 に記載の医薬組成物。

【請求項 18】

ポリマーは、約 1 : 1 の 4 - [ 2 - (シクロプロピルメトキシ) - 5 - メチルスルホニ

ルフェニル] - 2 - メチルイソキノリン - 1 - オン：ポリマーの比率で存在するヒドロキシプロピルメチルセルロースである、請求項 16 に記載の医薬組成物。

【請求項 19】

ポリマーは、約 1 : 3 の 4 - [ 2 - (シクロプロピルメトキシ) - 5 - メチルスルホニルフェニル] - 2 - メチルイソキノリン - 1 - オン：ポリマーの比率で存在するポリビニルピロリドンである、請求項 16 に記載の医薬組成物。

【請求項 20】

ポリマーは、約 1 : 1 の 4 - [ 2 - (シクロプロピルメトキシ) - 5 - メチルスルホニルフェニル] - 2 - メチルイソキノリン - 1 - オン：ポリマーの比率で存在するポリビニルピロリドンである、請求項 16 に記載の医薬組成物。

【請求項 21】

癌または他の腫瘍性疾患の処置のための薬物の調製のための、請求項 1 - 20 のいずれか 1 つに記載の医薬組成物の使用。

【請求項 22】

医薬組成物は、(a) 4 - [ 2 - (シクロプロピルメトキシ) - 5 - メチルスルホニルフェニル] - 2 - メチルイソキノリン - 1 - オンの非晶質形態と、(b) ポリビニルピロリドンまたはヒドロキシプロピルメチルセルロースから選択されたポリマーとを含む、固体のポリマーマトリックスを含み、固体のポリマーマトリックスは噴霧乾燥分散剤である、請求項 21 に記載の使用。